

Composition of ascorbyl compound and catechin, or extract containing it, useful for improving barrier properties of skin

Publication number: DE19962369 (A1)

Publication date: 2001-06-28

Inventor(s): SCHOENROCK UWE [DE]; RAPP CLAUDIUS [DE]; STEINKE SIGRID [DE]; FRAUEN MARKUS [DE]; RODE TIMO [DE] +

Applicant(s): BEIERSDORF AG [DE] +

Classification:

- international: A61K36/00; A61K36/82; A61K8/49; A61K8/67; A61K8/97; A61Q17/00; A61Q19/00; A61K36/00; A61K36/185; A61K8/30; A61K8/96; A61Q17/00; A61Q19/00; (IPC1-7): A61K35/78; A61K7/00; A61K7/48
- European: A61K8/49H2; A61K8/67H; A61K8/97; A61Q17/00; A61Q19/00; A61K36/82

Application number: DE19991062369 19991223

Priority number(s): DE19991062369 19991223

Cited documents:

- ☐ DE19838918 (A1)
- ☐ DE19827824 (A1)
- ☐ DE19824727 (A1)
- ☐ US5972999 (A)
- ☐ US5962517 (A)

Abstract of DE 19962369 (A1)

Active ingredient composition (A) comprises (i) an extract of a plant of the order Theales and/or catechins (i) and/or (i) gallate esters and (ii) at least one ascorbyl compound (ii), preferably water soluble. The extract is particularly derived from a plant of the family Theaceae, especially the tea plants *Camellia sinensis*, *C. assamica*, *C. taliensis*, *C. irrawadiensis* or their hybrids with e.g. *C. japonica*.

Data supplied from the **espacenet** database — Worldwide



19 BUNDESREPUBLIK
DEUTSCHLAND



DEUTSCHES
PATENT- UND
MARKENAMT

12 **Offenlegungsschrift**
10 **DE 199 62 369 A 1**

57 Int. Cl. 7:
A 61 K 7/00
A 61 K 7/48
A 61 K 35/78

21 Aktenzeichen: 199 62 369.4
22 Anmeldetag: 23. 12. 1999
44 Offenlegungstag: 28. 6. 2001

DE 199 62 369 A 1

71 Anmelder:
Beiersdorf AG, 20253 Hamburg, DE

72 Erfinder:
Schönrock, Uwe, Dr., 23866 Nahe, DE; Rapp,
Claudius, Dr., 20257 Hamburg, DE; Steinke, Sigrid,
21075 Hamburg, DE; Frauen, Markus, 20251
Hamburg, DE; Rode, Timo, 20255 Hamburg, DE

15 Für die Beurteilung der Patentfähigkeit in Betracht
zu ziehende Druckschriften:

DE 198 38 918 A1
DE 198 27 624 A1
DE 198 24 727 A1
US 59 72 999
US 59 62 517
US 57 80 088
WO 99 13 859 A1
WO 98 23 152 A1

JP Patents Abstracts of Japan:
59-227244 A., C- 278, April 25, 1985, Vol. 9, No. 96;
59-227243 A., C- 278, April 25, 1985, Vol. 9, No. 96;
09308833 A;
08119849 A;
07025742 A;

Die folgenden Angaben sind den vom Anmelder eingereichten Unterlagen entnommen

- 54 Kosmetische oder dermatologische Zubereitungen mit einem Gehalt an Catechinen oder einem Gehalt an Extrakt von grünem Tee und einem weiteren Gehalt an Ascorbinsäure
- 57 Wirkstoffkombinationen aus
- (a) Extrakten aus Blättern der Pflanzen der Ordnung Theales mit der Familie Theaceae, insbesondere der Spezies *Camellia spec.*, ganz besonders der Teesorten *Camellia sinensis*, *C. assamica*, *C. taliensis* bzw. *C. irrawadensis* und Kreuzungen aus diesen mit beispielsweise *Camellia japonica* und/oder
 - (b) Catechinen und/oder
 - (c) Gallussäureestern von Catechinen und
 - (d) einer oder mehreren Ascorbylverbindungen, insbesondere einer oder mehreren wasserlöslichen Ascorbylverbindungen, insbesondere Ascorbinsäure.

DE 199 62 369 A 1

Beschreibung

Die vorliegende Erfindung betrifft kosmetische bzw. dermatologische Zubereitungen, enthaltend Wirkstoffe zur Pflege und zum Schutze der Haut, insbesondere der empfindlichen und trockenen Haut wie auch ganz besonders im Vordergrund stehend der durch intrinsische und/oder extrinsische Faktoren gealterten oder alternenden Haut sowie die Verwendung solcher Wirkstoffe und Kombinationen solcher Wirkstoffe auf dem Gebiete der kosmetischen und dermatologischen Hautpflege.

Unter kosmetischer Hautpflege ist in erster Linie zu verstehen, daß die natürliche Funktion der Haut als Barriere gegen Umwelteinflüsse (z. B. Schmutz, Chemikalien, Mikroorganismen) und gegen den Verlust von körpereigenen Stoffen (z. B. Wasser, natürliche Fette, Elektrolyte) gestärkt oder wiederhergestellt wird.

Wird diese Funktion gestört, kann es zu verstärkter Resorption toxischer oder allergener Stoffe oder zum Befall von Mikroorganismen und als Folge zu toxischen oder allergischen Hautreaktionen kommen.

Ziel der Hautpflege ist es ferner, den durch tägliches Waschen verursachten Fett- und Wasserverlust der Haut auszugleichen. Dies ist gerade dann wichtig, wenn das natürliche Regenerationsvermögen nicht ausreicht. Außerdem sollen Hautpflegeprodukte vor Umwelteinflüssen, insbesondere vor Sonne und Wind, schützen und die Hautalterung verzögern.

Die Hornschicht der Haut zeichnet sich durch eine besondere Struktur aus, die einerseits die Haut vor Verlust an lebenswichtigem Zellwasser bzw. dem Eindringen von externen Noxen schützt und andererseits ihre eigene Flexibilität durch Bindung einer definierten Wassermenge stabilisiert: Interzellularlipide, bestehend aus freien Sterolen und Fettsäuren sowie verschiedenen Ceramidklassen, bilden innerhalb der Hornschicht eine Barriere in Form extrazellulärer, multilamellarer und wasserundurchlässiger Membransysteme aus.

Die Lipidmembranen umlagern die abgestorbenen Korneozyten mit eingelagerten hygrokopischen Stoffen. Die Hornschicht befindet sich in einem ständigen Erneuerungsprozess, wobei nach außen kontinuierlich feine Schuppen (Korneozyten mit anhaftenden Lipiden) abgegeben und von innen verhorntes Zell- und Lipidmaterial nachproduziert wird. Im Gleichgewicht verursacht der Regenerationsprozess also keine Veränderung des transepidermalen Wasserverlustes.

Schon bei einem einfachen Wasserbad ohne Zusatz von Tensiden kommt es zunächst zu einer Quellung der Hornschicht der Haut, wobei der Grad dieser Quellung beispielsweise von der Dauer des Bades und dessen Temperatur abhängt. Zugleich werden wasserlösliche Stoffe, z. B. wasserlösliche Schmutzbestandteile, auch durch hauttägliche Stoffe, die für das Wasserbindungsvermögen der Hornschicht verantwortlich sind, ab- bzw. ausgewaschen. Durch hauttägliche oberflächenaktive Stoffe werden zudem auch Hautfette in gewissem Ausmaße gelöst und ausgewaschen. Dies bedingt nach anfänglicher Quellung eine nachfolgende deutliche Austrocknung der Haut, die durch waschaktive Zusätze noch verstärkt werden kann.

Bei gesunder Haut sind diese Vorgänge im allgemeinen belanglos, da die Schutzmechanismen der Haut solche leichten Störungen der oberen Hautschichten ohne weiteres kompensieren können. Aber bereits im Falle nichtpathologischer Abweichungen vom Normalzustand, z. B. durch umweltbedingte Abnutzungsschäden bzw. Irritationen, Lichtschäden, Altershaut usw., ist der Schutzmechanismus der Hautoberfläche gestört. Unter Umständen ist er dann aus eigener Kraft nicht mehr in der Lage, seine Aufgabe zu erfüllen und muß durch externe Maßnahmen regeneriert werden.

Darüber hinaus ist bekannt, daß Lipidzusammensetzung und -menge der Hornschicht der pathologisch veränderten, trockenen und der trockenen, jedoch nicht erkrankten Haut jüngerer und älterer Menschen vom Normalzustand abweicht, der in der gesunden, normal hydrierten Haut einer gleichalten Altersgruppe vorgefunden wird. Dabei stellen die Veränderungen im Lipidmuster der sehr trockenen, nicht-ekzematischen Haut von Patienten mit atopischem Ekzem einen Extremfall für die Abweichungen dar, die in der trockenen Haut hautgesunder Menschen vorgefunden werden.

Diese Abweichungen betreffen dabei ganz besonders die Ceramide, die in ihrer Menge stark reduziert und zusätzlich anders zusammengesetzt sind. Auffallend ist dabei in besonderer Weise das Defizit an den Ceramiden 1 und 3, wobei insbesondere für das Ceramid 1 bekannt ist, daß es in besonderer Weise die Ordnung der Lipide in der Interzellularmembransystemen steigert.

Nachteilige Veränderungen in den Lipidmembranen der vorab geschilderten Art beruhen möglicherweise auf fehlergesteuerter Lipidbiosynthese und erhöhen ebenfalls im Endeffekt den transepidermalen Wasserverlust. Eine langanhaltende Barrierschwäche wiederum macht die an sich gesunde Haut empfindlicher und kann im Einzelfälle zum Entstehen ekzematöser Vorgänge in der kranken Haut beitragen.

Die Wirkung von Salben und Cremes auf Barrierefunktion und Hydratation der Hornschicht besteht in der Regel nicht in einer Wiederherstellung bzw. Stärkung der physikalisch-chemischen Eigenschaften der Lamellen aus Interzellularlipiden. Ein wesentlicher Teileffekt beruht auf der bloßen Abdeckung der behandelten Hautoberfläche und dem daraus resultierenden Wasserstau in der darunterliegenden Hornschicht. Komplizierte hygrokopische Substanzen binden das Wasser, so daß es zu einer meßbaren Zunahme des Wassergehaltes in der Hornschicht kommt. Diese rein physikalische Barriere kann jedoch relativ leicht wieder entfernt werden. Nach dem Absetzen des Produktes kehrt die Haut dann sehr schnell wieder den Zustand vor Behandlungsbeginn zurück. Darüber hinaus kann die Hautpflegewirkung bei regelmäßiger Behandlung nachlassen, so daß schließlich sogar während der Behandlung der Status quo wieder erreicht wird. Bei bestimmten Produkten verschlechtert sich der Zustand der Haut nach Absetzen unter Umständen vorübergehend. Eine nachhaltige Produktwirkung wird in der Regel also nicht oder nur in einem eingeschränkten Maße erreicht.

Um die defizitiäre Haut bei ihrer natürlichen Regeneration zu unterstützen und ihre physiologische Funktion zu stärken, werden topischen Präparaten in neuerer Zeit zunehmend Interzellularlipidmischungen zugesetzt, die von der Haut zum Wiederaufbau der natürlichen Barriere verwendet werden sollen. Allerdings handelt es sich bei diesen Lipiden, insbesondere aber den Ceramiden, um sehr teure Rohstoffe. Zudem ist ihre Wirkung meist sehr viel geringer als erhofft.

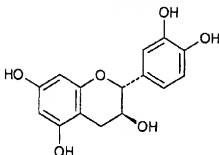
Ziel der vorliegenden Erfindung war es somit, Wege zu finden, die Nachteile des Standes der Technik zu vermeiden. Insbesondere sollte die Wirkung der Hautpflegeprodukte physiologisch, schnell und nachhaltig sein.

Erfindungsgemäß werden diese Aufgaben gelöst durch Gegenstand der Erfindung sind ferner die Verwendung von Catechinen oder Gallussäureestern von Catechinen oder wäßriger bzw. organischer Extrakte aus Pflanzen oder Pflanzen-

len, die einen Gehalt an Catechinen oder Gallussäureestern von Catechinen aufweisen, beispielsweise den Blättern der Pflanzenfamilie Theaceae, insbesondere der Spezies *Camellia sinensis* (grüner Tee) bzw. deren typische Inhaltsstoffe (wie z. B. Polyphenole bzw. Catechine, Coffein, Vitamine, Zucker, Mineralien, Aminosäuren, Lipide), zur Prophylaxe, Behandlung und/oder Pflege trockener Hautzustände.

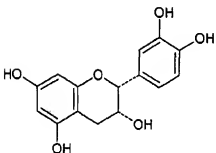
Catechine stellen eine Gruppe von Verbindungen dar, die als hydrierte Flavone oder Anthocyanidine aufzufassen sind. Die Catechine bilden die Grundsubstanz einer Reihe natürlicher oligo- oder polymerer Gerbstoffe, z. B. im Tee. Sie kommen zusammen mit anderen Phenolen in vielen Obstsorten vor und sind an der durch Phenoloxidasen katalysierten Bräunung von Druck- und Schnittstellen (z. B. bei Äpfeln) beteiligt.

Der Grundkörper, das "Catechin" (Catechol, 3,3',4',5,7-Flavanpentaol, 2-(3,4-Dihydroxyphenyl)-chroman-3,5,7-triol) ist weitverbreitet in Pflanzen und kommt beispielsweise im Catechu vor. Es ist durch die Strukturformel



gekennzeichnet.

Das Epicatechin ((2R,3R)-3,3',4',5,7-Flavanpentaol) stellt ein Isomeres des Catechins dar und ist durch die Strukturformel



gekennzeichnet.

Die erfindungsgemäßen Aufgaben werden ebenfalls gelöst durch kosmetische oder dermatologische Zubereitungen enthaltend pflanzliche Auszüge mit einem Gehalt an Catechinen, insbesondere solche Zubereitungen, die Extrakte des grünen Tees enthalten.

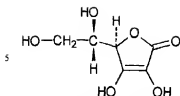
Tee stammt ausschließlich aus Blättern, Blattknospen und zarten Stielen des Teestrauches (*Camellia sinensis* L.), die nach Verfahren wie Welken, Rollen, Fermentieren, Zerkleinern und Trocknen bearbeitet werden. Schwarzer Tee ist ein fermentierter Tee, Oolong-Tee ist ein halb fermentierter Tee, dessen Blätter nach Welken u. Rollen nur die Hälfte der sonst üblichen Zeit fermentiert und anschließend getrocknet werden. Grüner Tee ist ein unfermentiertes Erzeugnis, dessen Blätter blanchiert, gerollt und unter Erhalt der natürlichen Blattfarbstoffe getrocknet werden.

Die Zusammensetzung der Inhaltsstoffe der Teeblätter schwankt je nach Herkunft und Behandlung beträchtlich. Im Durchschnitt enthält schwarzer Tee 18,9% Catechine und Catechin-Gerbstoffe, 16,6% Proteine, 2,7% Coffein, 10,2% andere Stickstoffverbindungen, 4,6% Oligosaccharide, 0,6% Stärke, 11,9% Pektin, 7,9% Cellulose und 6,1% Lignin. Frische Blätter weisen im wesentlichen die gleiche Zusammensetzung auf, enthalten jedoch mehr Catechine (26%), weniger Stickstoffverbindungen (8,7%, bei gleichem Coffein-Gehalt) sowie 0,8% Inositol. In den Polyphenol-Gerbstoffen finden sich zu etwa 80% Catechine (Hauptbestandteil Galloyl(-)-epigallocatechin).

Nachteilig an Catechinen oder Gallussäureestern von Catechinen oder wäßriger bzw. organischer Extrakte aus Pflanzen oder Pflanzenteilen, die einen Gehalt an Catechinen oder Gallussäureestern von Catechinen aufweisen, beispielsweise den Blättern der Pflanzenfamilie Theaceae, insbesondere der Spezies *Camellia sinensis* (Grüner Tee), ist, daß ihre Lagerstabilität äußerst knapp begrenzt ist. Bereits nach für kosmetische oder dermatologische Zubereitungen inakzeptabel kurzer Zeit degenerieren diese Substanzen, wodurch ihre physiologische Wirksamkeit bereits rasch herabgesetzt bzw. gänzlich zunichte gemacht wird.

Diesem Übelstande galt es, Abhilfe zu schaffen.

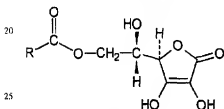
Die Verwendung der Ascorbinsäure in Kosmetika und Dermatika ist an sich bekannt. L-Ascorbinsäure ((R)-5-[(S)-1,2-Dihydroxyethyl]-3,4-dihydroxy-5-H-furan-2-on, Vitamin C) zeichnet sich durch die Strukturformel



aus. Sie ist leicht löslich in Wasser, gut löslich in Alkohol, unlöslich in Ether, Petrolether, Chloroform, Benzol sowie in Fetten u. fetten Ölen. Ascorbinsäure ist ein Endiol und wirkt als Reduktion stark reduzierend. Ascorbinsäure ist wärmeempfindlich und wird insbesondere in Gegenwart von Schwermetallspuren sowie in alkalischem Milieu durch Licht und Luftsauerstoff zersetzt, in reinem, trockenem Zustand ist sie dagegen relativ beständig gegen Licht, Luft und Wärme.

In kosmetischen und dermatologischen Zubereitungen werden anstatt der Ascorbinsäure oftmals Ascorbylverbindungen, bevorzugt Ascorbylester von Fettsäuren, besonders bevorzugt Ascorbylpalmitat eingesetzt, da die Empfindlichkeit dieser Verbindungen auf oxidativen Einfluß gegenüber der Ascorbinsäure stark herabgesetzt ist und diese Verbindungen zumeist besser öllöslich sind, was galenische Vorteile bieten kann.

Ascorbylverbindungen im engeren Sinne sind insbesondere die Ascorbylester der allgemeinen Struktur



wobei R einen verzweigten oder unverzweigten Alkylrest mit bis zu 25 Kohlenstoffatomen darstellen kann.

Überschenderweise wurde gefunden, daß Wirkstoffkombinationen aus

- 30
- (a) Extrakten aus Blättern der Pflanzen der Ordnung Theales mit der Familie Theaceae, insbesondere der Spezies *Camellia spec.*, ganz besonders der Teesorten *Camellia sinensis*, *C. assamica*, *C. taliensis* bzw. *C. irrawadiensis* und Kreuzungen aus diesen mit beispielsweise *Camellia japonica* und/oder
 - 35 (b) Catechinen und/oder
 - (c) Gallussäureestern von Catechinen und
 - (d) einer oder mehreren Ascorbylverbindungen, insbesondere einer oder mehreren wasserlöslichen Ascorbylverbindungen, insbesondere Ascorbinsäure,

die Aufgaben erfindungsgemäß lösen.

40 Gegenstand der Erfindung ist ferner die Verwendung

- (d) einer oder mehreren Ascorbylverbindungen, insbesondere einer oder mehreren wasserlöslichen Ascorbylverbindungen, insbesondere Ascorbinsäure,
- 45 zur Stabilisierung bzw. Verbesserung der Lagerfähigkeit von
- (a) Extrakten aus Blättern der Pflanzen der Ordnung Theales mit der Familie Theaceae, insbesondere der Spezies *Camellia spec.*, ganz besonders der Teesorten *Camellia sinensis*, *C. assamica*, *C. taliensis* bzw. *C. irrawadiensis* und Kreuzungen aus diesen mit beispielsweise *Camellia japonica* und/oder
- 50 (b) Catechinen und/oder
- (c) Gallussäureestern von Catechinen.

Die Verwirklichung der Erfindung findet bevorzugt in kosmetischen oder dermatologischen Zubereitungen statt, insbesondere bevorzugt in Hautpflegeprodukten.

55 Vorteilhaft enthalten erfindungsgemäße Zubereitungen 0,0001–20 Gew.-% an Catechinen oder Gallussäureestern von Catechinen oder an wäßrigen bzw. organischen Extrakten aus Pflanzen oder Pflanzenteilen, die einen Gehalt an Catechinen oder Gallussäureestern von Catechinen aufweisen, vorzugsweise Polyphenole bzw. Catechine aus der Gruppe (–)–Catechin, (+)–Catechin, (–)–Catechingallat, (–)–Gallocatechingallat, (+)–Epicatechin, (–)–Epicatechin, (–)–Epicatechingallat, (–)–Epigallocatechin, (–)–Epigallocatechingallat.

60 Bevorzugt enthalten kosmetische oder dermatologische Zubereitungen gemäß der Erfindung 0,001–10 Gew.-% an Catechinen oder Gallussäureestern von Catechinen oder an wäßrigen bzw. organischen Extrakten aus Pflanzen oder Pflanzenteilen, die einen Gehalt an Catechinen oder Gallussäureestern von Catechinen aufweisen, bezogen auf die Gesamtzusammensetzung der Zubereitungen.

Ganz besonders bevorzugt enthalten kosmetische oder dermatologische Zubereitungen gemäß der Erfindung 0,01–1 Gew.-% an Catechinen oder Gallussäureestern von Catechinen oder an wäßrigen bzw. organischen Extrakten aus Pflanzen oder Pflanzenteilen, die einen Gehalt an Catechinen oder Gallussäureestern von Catechinen aufweisen, bezogen auf die Gesamtzusammensetzung der Zubereitungen.

Die Ascorbylverbindung oder die Ascorbylverbindungen, insbesondere Vitamin C und/oder Derivate wie z. B. Ascor-

bylpalmitat, Mg-Ascorbylphosphat, Ascorbylacetat, ist bzw. sind erfindungsgemäß vorteilhaft in kosmetischen oder dermatologischen Zubereitungen bevorzugt zu 0,001 Gew.-% bis 10 Gew.-%, bevorzugt zu 0,05 Gew.-% bis 5 Gew.-%, insbesondere bevorzugt zu 0,1 2,0 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen, enthalten.

Die erfindungsgemäßen topischen Zubereitungen können als flüssige, pastöse oder feste Zubereitungen formuliert werden, beispielsweise als wäßrige oder alkoholische Lösungen, wäßrige Suspensionen, Emulsionen, Salben, Cremes, Gele, Öle, Pulver oder Stifte. In Abhängigkeit von der gewünschten Formulierung können Wirkstoffe in pharmazeutische und kosmetische Grundlagen für topische Applikationen eingearbeitet werden, die als weitere Komponenten beispielsweise Ölkomponenten, Fett und Wachs, Emulgatoren, anionische, kationische, ampholytische, zwittrionische und/oder nichtionische Tenside, niedere ein- und mehrwertige Alkohole, Wasser, Konservierungsmittel, Verdickungsmittel, Duftstoffe, Farbstoffe und Trübungsmittel enthalten. Vorteilhafte können die erfindungsgemäßen Wirkstoffe auch in transdermalen therapeutischen Systemen, insbesondere kutiblen Systemen verwendet werden.

Es ist von Vorteil, den pflegenden topischen Zubereitungen Zusatzstoffe wie Vitamine, Coenzyme, Substrate und Hilfsfaktoren des Lipidstoffwechsels oder des Energiestoffwechsels oder sonstige kosmetische oder dermatologische Hilfs- oder Wirkstoffe zuzusetzen, beispielsweise Pyridoxin, Pyridoxal, Pyridoxamin, Uridin, L-Serin, schwache Carbonsäuren, deren pK_s -Wert zwischen 3 und 5,5 liegt (z. B. Milchsäure und Propionsäure), Citronensäure, Pyruvat sowie zelluläre Energieüberträger (z. B. Kreatin, Guanin, Guanidin, Adenin, Adenosin, Nicotin, Nicotinamid, Riboflavin), Coenzyme (z. B. Coenzym Q_{10} , Pantothenäure, Panthothol, Liponsäure), Hilfsfaktoren (z. B. L-Carnitin), Substrate (z. B. Hexosen, Pentosen, Fettsäuren), Taurocholsäure, Lipide (z. B. Ceramide, Cholesterin, Fettsäuren, Sphingosin, Sphingomyelin, Glucocerebroside), Substrate (z. B. Hexosen, Pentosen, Fettsäuren), Glutathion und/oder natürliche Befeuchtungsfaktoren (z. B. Aminosäuren, Hamstoff, Pyrrolidonecarbonsäure, Glycerin).

Es ist auch von Vorteil, den erfindungsgemäßen Zubereitungen Antioxidantien zuzusetzen. Vorteilhafte werden die Antioxidantien gewählt aus der Gruppe bestehend aus Aminosäuren (z. B. Glycin, Histidin, Tyrosin, Tryptophan) und deren Derivate, Imidazole (z. B. Urocaninsäure) und deren Derivate, Peptide wie D,L-Carnosin, D-Carnosin, L-Carnosin und deren Derivate (z. B. Anserin), Carotinoide, Carotine (z. B. α -Carotin, β -Carotin, Lycopin) und deren Derivate, Chlorogensäure und deren Derivate, Liponsäure und deren Derivate (z. B. Dihydroliponsäure), Aurothioglucose, Propylthiouracil und andere Thiole (z. B. Thioredoxin, Glutathion, Cystein, Cystin, Cystamin und deren Glycosyl-, N-Acetyl-, Methyl-, Äthyl-, Propyl-, Amyl-, Butyl- und Lauryl-, Palmitoyl-, Ölethyl-, γ -Linolethyl-, Cholesteryl- und Glycerylester) sowie deren Salze, Dialkarylthiodipropionat, Diäthylthiodipropionat, Ithiodipropionsäure und deren Derivate (Ester, Ether, Peptide, Lipide, Nukleotide, Nukleoside und Salze) sowie Sulfoximinverbindungen (z. B. Buthioninsulfoximin, Homocysteinylsulfoximin, Buthioninsulfoximin, Penta-, Hexa-, Heptathioninsulfoximin) in sehr geringen verträglichen Dosierungen (z. B. $pmol$ bis $\mu mol/kg$), ferner (Metall)-Chelatoren (z. B. α -Hydroxyfettsäuren, Palmitinsäure, Phytinsäure, Lactoferrin, α -Hydroxysäuren (z. B. Citronensäure, Milchsäure, Äpfelsäure), Huminsäure, Gallussäure, Gallusextrakte, Bilirubin, Biliverdin, EDTA, EGTA und deren Derivate, ungesättigte Fettsäuren und deren Derivate (z. B. γ -Linolensäure, Linolensäure, Ölsäure), Folsäure und deren Derivate, Ubichinon und Ubichinol und deren Derivate, Tocopherole und Derivate (z. B. Vitamin-E-acetat), Vitamin A und Derivate (Vitamin-A-palmitat) sowie Koniferylbenzoat des Benzoeharzes, Rutinsäure und deren Derivate, α -Glycosylrutin, Ferulasäure, Furfurylidenglicolol, Carnosin, Butylhydroxytoluol, Butylhydroxyanisol, Nordihydroguajakarzinsäure, Nordihydroguajarsäure, Trihydroxybutyrophonon, Harnsäure und deren Derivate, Mannose und deren Derivate, Zink und dessen Derivate (z. B. ZnO , $ZnSO_4$) Selen und dessen Derivate (z. B. Selenmethionin), Silbene und deren Derivate (z. B. Stilbenoxid, Trans-Stilbenoxid) und die erfindungsgemäß geeigneten Derivate (Salze, Ester, Ether, Zucker, Nukleotide, Nukleoside, Peptide und Lipide) dieser genannten Wirkstoffe, Günstig sind auch solche kosmetischen und dermatologischen Zubereitungen, die in der Form eines Sonnenschutzmittels vorliegen, Vorzugsweise enthalten diese neben den erfindungsgemäßen Wirkstoffkombinationen zusätzlich mindestens eine UV-A-Filtersubstanz und/oder mindestens eine UV-B-Filtersubstanz und/oder mindestens ein anorganisches Pigment.

Es ist aber auch vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindungen, solche kosmetischen und dermatologischen Zubereitungen zu erstellen, deren hauptsächlichster Zweck nicht der Schutz vor Sonnenlicht ist, aber dennoch einen Gehalt an UV-Schutzsubstanzen enthalten. So werden z. B. in Tagescremes gewöhnlich UV-A- bzw. UV-B-Filtersubstanzen eingebeibet.

Auch stellen UV-Schutzsubstanzen, ebenso wie Antioxidantien, und, gewünschtenfalls, Konservierungsstoffe, einen wirksamen Schutz der Zubereitungen selbst gegen Verderb dar.

Vorteilhafte können erfindungsgemäße Zubereitungen außerdem Substanzen enthalten, die UV-Strahlung im UVB-Bereich absorbieren, wobei die Gesamtmenge der Filtersubstanzen z. B. 0,1 Gew.-% bis 30 Gew.-%, vorzugsweise 0,5 bis 10 Gew.-%, insbesondere 1,0 bis 6,0 Gew.-% beträgt, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen, um kosmetische Zubereitungen zur Verfügung zu stellen, die das Haar bzw. die Haut vor dem gesamten Bereich der ultravioletten Strahlung schützen. Sie können auch als Sonnenschutzmittel fürs Haar oder die Haut dienen.

Enthalten die erfindungsgemäßen Zubereitungen UVB-Filtersubstanzen, können diese öllöslich oder wasserlöslich sein. Erfindungsgemäß vorteilhafte öllösliche UVB-Filter sind z. B.:

- 3-Benzylidencampher-Derivate, vorzugsweise 3-(4-Methylbenzyliden)campher, 3-Benzylidencampher;
- 4-Aminobenzoensäure-Derivate, vorzugsweise 4-(Dimethylamino)-benzoensäure(2-ethylhexyl)ester, 4-(Dimethylamino)benzoensäureamylester;
- Ester der Zimtsäure, vorzugsweise 4-Methoxyzimtsäure(2-ethylhexyl)ester, 4-Methoxyzimtsäureisopentylester;
- Ester der Salicylsäure, vorzugsweise Salicylsäure(2-ethylhexyl)ester, Salicylsäure(4-isopropylbenzyl)ester, Salicylsäurehomomenthylster;
- Derivate des Benzophenons, vorzugsweise 2-Hydroxy-4-methoxybenzophenon, 2-Hydroxy-4-methoxy-4'-methylbenzophenon, 2,2'-Dihydroxy-4-methoxybenzophenon; Ester der Benzaldehydsäure, vorzugsweise 4-Methoxybenzaldehydsäure(2-ethylhexyl)ester;
- Derivate des 1,3,5-Triazins, vorzugsweise 2,4,6-Triamino-(p-carbo-2'-ethyl-1'-hexyloxy)-1,3,5-triazin.

Die Liste der genannten UVB-Filter, die in Kombination mit den erfindungsgemäßen Wirkstoffkombinationen verwendet werden können, soll selbstverständlich nicht limitierend sein.

- Es kann auch von Vorteil sein, erfindungsgemäße Zubereitungen mit UVA-Filtern zu formulieren, die bisher üblicherweise in kosmetischen Zubereitungen enthalten sind. Bei diesen Substanzen handelt es sich vorzugsweise um Derivate des Dihydroxymethans, insbesondere um 1-(4'-tert.-Butylphenyl)-3-(4'-methoxyphenyl)propan-1,3-diol und um 1-Phenyl-3-(4'-isopropylphenyl)propan-1,3-diol.

Gegenstand der Erfindung sind also auch die Kombinationen der erfindungsgemäßen Wirkstoffe, insbesondere in den topischen Zubereitungen, mit Antioxidantien, Stoffen des aeroben zellulären Energiestoffwechsels und/oder UV-Absorbieren, durch die sich z. B. die Stabilität und die Wirkung der Zubereitung verbessern läßt.

Die vorstehend aufgeführten Beispiele für kombinierbare Wirkstoffe aus den angegebenen Wirkstoffgruppen dienen dazu, die Erfindung zu beschreiben, ohne daß beabsichtigt ist, die Erfindung auf diese Beispiele zu beschränken.

Darüber hinaus können schützende Formulierungsformen angewendet werden, wobei die erfindungsgemäßen Stoffe z. B. in Liposomen, Micellen, Nanosphären usw. aus z. B. hydrierten Amphiphilen, wie z. B. Ceramiden, Fettsäuren, Sphingomyelin und Phosphoglyceriden bzw. in Cyclodextrane eingeschlossen (verkapselt) werden. Weiterer Schutz kann durch die Verwendung von Schutzgas (z. B. N₂, CO₂) bei der Formulierung und die Verwendung gasdichter Verpackungsformen erreicht werden.

Weitere Hilfs- und Zusatzstoffe können wasserbindende Stoffe, Verdicker, Füllstoffe, Parfüm, Farbstoffe, Imitigatoren, Wirkstoffe wie Vitamine, Konservierungsmittel, Wasser und/oder Salze sein.

Die erfindungsgemäßen Stoffgruppen lassen sich in alle kosmetischen Grundlagen einarbeiten. Grundsätzlich sind allerdings W/O- und O/W- und W/O/W-Emulsionen, Hydrodispersionen und Lipiddispersionen bevorzugt. Besonders vorteilhaft können erfindungsgemäße Kombinationen in Pflegeprodukte wie beispielsweise O/W-Cremes, W/O-Cremes, O/W-Lotionen usw. eingesetzt werden.

Die Lipidphase kann vorteilhaft gewählt werden aus folgender Substanzgruppe:

- Mineralöle, Mineralwachs
- Öle, wie Triglyceride der Caprin- oder der Caprylsäure, vorzugsweise aber Rizinusöl;
- Fette, Wachs und andere natürliche und synthetische Fettkörper, vorzugsweise Ester von Fettsäuren mit Alkoholen niedriger C-Zahl, z. B. mit Isopropanol, Propylenglykol oder Glycerin, oder Ester von Fettkohlolen mit Alkansäuren niedriger C-Zahl oder mit Fettsäuren;
- Alkylbenzoate;
- Silikonöle wie Dimethylpolysiloxane, Diethylpolysiloxane, Diphenylpolysiloxane sowie Mischformen daraus.

Die Ölphase der Emulsionen, Oleogele bzw. Hydrodispersionen oder Lipiddispersionen im Sinne der vorliegenden Erfindung wird vorteilhaft gewählt aus der Gruppe der Ester aus gesättigten und/oder ungesättigten, verzweigten und/oder unverzweigten Alkanecarbonsäuren einer Kettenlänge von 3 bis 30 C-Atomen und gesättigten und/oder ungesättigten, verzweigten und/oder unverzweigten Alkoholen einer Kettenlänge von 3 bis 30 C-Atomen, aus der Gruppe der Ester aus aromatischen Carbonsäuren und gesättigten und/oder ungesättigten, verzweigten und/oder unverzweigten Alkoholen einer Kettenlänge von 3 bis 30 C-Atomen. Solche Esteröle können dann vorteilhaft gewählt werden aus der Gruppe Isopropylmyristat, Isopropylpalmitat, Isopropylstearat, Isopropyloleat, n-Butylstearat, n-Hexylaurat, n-Decyloleat, Isooctylstearat, Isononylstearat, Isononylisononanoat, 2-Ethylhexylpalmitat, 2-Ethylhexylaurat, 2-Hexyldecylstearat, 2-Octyldodecylpalmitat, Oleyloleat, Oleylerucet, Erucyloleat, Erucylerucet sowie synthetische, halbsynthetische und natürliche Gemische solcher Ester, z. B. Jojobaöl.

Ferner kann die Ölphase vorteilhaft gewählt werden aus der Gruppe der verzweigten und unverzweigten Kohlenwasserstoffe und -wachs, der Silikonöle, der Dialkylether, der Gruppe der gesättigten oder ungesättigten, verzweigten oder unverzweigten Alkohole, sowie der Fettsäuretriglyceride, namentlich der Triglyceridester gesättigter und/oder ungesättigter, verzweigter und/oder unverzweigter Alkanecarbonsäuren einer Kettenlänge von 8 bis 24, insbesondere 12-18 C-Atomen. Die Fettsäuretriglyceride können beispielsweise vorteilhaft gewählt werden aus der Gruppe der synthetischen, halbsynthetischen und natürlichen Öle, z. B. Olivenöl, Sonnenblumenöl, Sojaöl, Erdnußöl, Rapsöl, Mandelöl, Palmöl, Kokoöl, Palmkernöl und dergleichen mehr.

Auch beliebige Abmischungen solcher Öl- und Wachskomponenten sind vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung einzusetzen. Es kann auch gegebenenfalls vorteilhaft sein, Wachs, beispielsweise Cetylpalmitat, als alleinige Lipidkomponente der Ölphase einzusetzen.

Vorteilhaft wird die Ölphase gewählt aus der Gruppe 2-Ethylhexylisostearat, Octyldodecanol, Isotridecylisononanoat, Isocicosan, 2-Ethylhexylcoctat, C₁₂₋₁₅-Alkylbenzoat, Capryl-Caprinäure-triglycerid, Diacetyllyther.

Besonders vorteilhaft sind Mischungen aus C₁₂₋₁₅-Alkylbenzoat und 2-Ethylhexylisostearat, Mischungen aus C₁₂₋₁₅-Alkylbenzoat und Isotridecylisononanoat sowie Mischungen aus C₁₂₋₁₅-Alkylbenzoat, 2-Ethylhexylisostearat und Isotridecylisononanoat.

Von den Kohlenwasserstoffen sind Paraffinöl, Squalan und Squalen vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung zu verwenden.

Vorteilhaft kann die Ölphase ferner einen Gehalt an cyclischen oder linearen Silikonölen aufweisen oder vollständig aus solchen Ölen bestehen, wobei allerdings bevorzugt wird, außer dem Silikonöl oder den Silikonölen einen zusätzlichen Gehalt an anderen Ölphasenkomponenten zu verwenden.

Vorteilhaft wird Cyclomethicon (Octamethylcyclotetrasiloxan) als erfindungsgemäß zu verwendendes Silikonöl eingesetzt. Aber auch andere Silikonöle sind vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung zu verwenden, beispielsweise Hexamethylcyclotrisiloxan, Polydimethylsiloxan, Poly(methylphenylsiloxan).

Besonders vorteilhaft sind ferner Mischungen aus Cyclomethicon und Isotridecylisononanoat, aus Cyclomethicon und 2-Ethylhexylisostearat.

Die wäßrige Phase der erfindungsgemäßen Zubereitungen enthält gegebenenfalls vorliegend

Alkohole, Diöle oder Polyole niedriger C-Zahl, sowie deren Ether, vorzugsweise Ethanol, Isopropanol, Propylenglykol, Glycerin, Ethylenglykol, Ethylenglykolmonoethyl- oder -monobutylether, Propylenglykolmonomethyl-, -monoethyl- oder -monobutylether, Diethylenglykolmonomethyl- oder -monoethylether und analoge Produkte, ferner Alkohole niedriger C-Zahl, z. B. Ethanol, Isopropanol, 1,2-Propanediol, Glycerin sowie insbesondere ein oder mehrere Verdickungsmittel, welches oder welche vorteilhaft gewählt werden können aus der Gruppe Siliciumdioxid, Aluminiumsilikate, Polysaccharide bzw. deren Derivate, z. B. Hyaluronsäure, Xanthangummi, Hydroxypropylmethylcellulose, besonders vorteilhaft aus der Gruppe der Polyacrylate, bevorzugt ein Polyacrylat aus der Gruppe der sogenannten Carbopole, beispielsweise Carbopole der Typen 980, 981, 1382, 2984, 5984, jeweils einzeln oder in Kombination.

Im technischen Sinne werden unter Gelen verstanden: Relativ formbeständige, leicht verformbare disperse Systeme aus zumindest zwei Komponenten, welche in der Regel aus einem – meist festen – kolloid zerteilten Stoff aus langkettigen Molekülgruppierungen (z. B. Gelatine, Kieselsäure, Polysaccharide) als Gerüstbildner und einem flüssigen Dispersionsmittel (z. B. Wasser) bestehen. Der kolloidal zerteilte Stoff wird oft als Verdickungs- oder Geliemittel bezeichnet. Er bildet ein räumliches Netzwerk im Dispersionsmittel, wobei einzelne kolloidal vorliegende Partikel über elektrostatische Wechselwirkung miteinander mehr oder weniger fest verknüpft sein können. Das Dispersionsmittel, welches das Netzwerk umgibt, zeichnet sich durch elektrostatische Affinität zum Geliemittel aus, d. h., ein vorwiegend polares (insbesondere: hydrophiles) Geliemittel gelöst vorzugsweise ein polares Dispersionsmittel (insbesondere: Wasser), wohingegen ein vorwiegend unpolares Geliemittel vorzugsweise unpolare Dispersionsmittel gelöst.

Starke elektrostatische Wechselwirkungen, welche beispielsweise in Wasserstoffbrückenbindungen zwischen Geliemittel und Dispersionsmittel, aber auch zwischen Dispersionsmittelmolekülen untereinander verwirklicht sind, können zu starker Vernetzung auch des Dispersionsmittels führen. Hydrogele können zu fast 100% aus Wasser bestehen (neben beispielsweise ca. 0,2–1,0% eines Geliemittels) und dabei durchaus feste Konsistenz besitzen. Der Wasseranteil liegt dabei in eisähnlichen Strukturelementen vor, so daß Gele daher ihrer Namensherkunft (aus lat. "gelatum" = "Gefrorenes" über den alchimistischen Ausdruck "gelatina" (16. Jhdt.) für nhdt. "Gelatine") durchaus gerecht werden.

Gele gemäß der Erfindung enthalten üblicherweise Alkohole niedriger C-Zahl, z. B. Ethanol, Isopropanol, 1,2-Propanediol, Glycerin und Wasser in Gegenwart eines Verdickungsmittels, das bei ölig-alkoholischen Gelen vorzugsweise Siliciumdioxid oder ein Aluminiumsilikat, bei wäßrig-alkoholischen oder alkoholischen Gelen vorzugsweise ein Polyacrylat ist.

Zubereitungen gemäß der Erfindung können beispielsweise auch als Schaum- und Duschbäder, feste und flüssige Seifen oder sogenannte "Syndets" (synthetische Detergentien), Shampoos, Handwaschpasten, Intimwaschmittel, spezielle Reinigungsmittel für Kleinkinder und dergleichen ausgestaltet werden.

Erfindungsgemäße Zubereitungen können sich gegebenenfalls vorteilhaft durch einen Gehalt an Tensiden auszeichnen. Tenside sind amphipile Stoffe, die organische, unpolare Substanzen in Wasser lösen können. Sie sorgen, bedingt durch ihren spezifischen Molekülaufbau mit mindestens einem hydrophilen und einem hydrophoben Molekülteil, für eine Herabsetzung der Oberflächenspannung des Wassers, die Benetzung der Haut, die Erleichterung der Schmutzentfernung und -lösung, ein leichtes Abspülen und – je nach Wunsch – für Schaumregulierung.

Bei den hydrophilen Anteilen eines Tensidmoleküls handelt es sich meist um polare funktionelle Gruppen, beispielsweise -COO⁻, -OSO₃²⁻, -SO₃⁻, während die hydrophoben Teile in der Regel unpolare Kohlenwasserstoffreste darstellen. Tenside werden im allgemeinen nach Art und Ladung des hydrophilen Molekülteils klassifiziert. Hierbei können vier Gruppen unterschieden werden:

- anionische Tenside,
- kationische Tenside,
- amphotere Tenside und
- nichtionische Tenside.

Anionische Tenside weisen als funktionelle Gruppen in der Regel Carboxylat-, Sulfat- oder Sulfonatgruppen auf. In wäßriger Lösung bilden sie im sauren oder neutralen Milieu negativ geladene organische Ionen. Kationische Tenside sind beinahe ausschließlich durch das Vorhandensein einer quaternären Ammoniumgruppe gekennzeichnet. In wäßriger Lösung bilden sie im sauren oder neutralen Milieu positiv geladene organische Ionen. Amphotere Tenside enthalten sowohl anionische als auch kationische Gruppen und verhalten sich demnach in wäßriger Lösung je nach pH-Wert wie anionische oder kationische Tenside. Im stark sauren Milieu besitzen sie eine positive und im alkalischen Milieu eine negative Ladung. Im neutralen pH-Bereich hingegen sind sie zwitterionisch, wie das folgende Beispiel verdeutlichen soll:

$\text{RNH}_3^+\text{CH}_2\text{CH}_2\text{COOH}^- \text{X}^-$ (bei pH = 2) X⁻ = beliebiges Anion, z. B. Cl⁻
 $\text{RNH}_3^+\text{CH}_2\text{CH}_2\text{COO}^-$ (bei pH = 7)
 $\text{RNH}_3^+\text{CH}_2\text{CH}_2\text{COO}^- \text{B}^+$ (bei pH = 12) B⁺ = beliebiges Kation, z. B. Na⁺

Typisch für nicht-ionische Tenside sind Polyether-Ketten. Nicht-ionische Tenside bilden in wäßrigem Medium keine Ionen.

A. Anionische Tenside

Vorteilhaft zu verwendende anionische Tenside sind Acylaminosäuren (und deren Salze), wie

1. Acylglutamate, beispielsweise Natriumacylglutamat, Di-TEA-palmitoylaspartat und Natrium Caprylic/Capric Glutamat,

2. Acylpeptide, beispielsweise Palmitoyl-hydrolysiertes Milchprotein, Natrium Cocoylhydrolysiertes Soja Protein und Natrium-/Kalium Cocoylhydrolysiertes Kollagen,
3. Sarcosinate, beispielsweise Myristoyl Sarcosin, TEA-lauroyl Sarcosinat, Natriumlauroylsarcosinat und Natriumcocoylsarcosinat,
4. Taurate, beispielsweise Natriumlauroyltaurat und Natriummethylcocoyltaurat,
5. Acyllactylate, lauroyllactylat, Caproyllactylat
6. Alaninate

Carbonsäuren und Derivate, wie

1. Carbonsäuren, beispielsweise Laurinsäure, Aluminiumstearat, Magnesiumalkanolat und Zinkundecylenat,
2. Ester-Carbonsäuren, beispielsweise Calciumstearoyllactylat, Laureth-6 Citrat und Natrium PEG-4 Lauramidcarboxylat,
3. Ether-Carbonsäuren, beispielsweise Natriumlaureth-13 Carboxylat und Natrium PEG-6 Cocanide Carboxylat

Phosphorsäureester und Salze, wie beispielsweise DEA-Oleth-10-Phosphat und Dilaureth-4 Phosphat, Sulfonsäuren und Salze, wie

1. Acyl-isethionate, z. B. Natrium-/Ammoniumcocoyl-isethionat,
2. Alkylarylsulfonate,
3. Alkylsulfonate, beispielsweise Natriumcocosinonoglyceridsulfat, Natrium C₁₂₋₁₄-Olefin sulfonat, Natriumlaurylsulfosuccinat und Magnesium PEG-3 Cocamidsulfat,
4. Sulfosuccinate, beispielsweise Dioctylnatriumsulfosuccinat, Dinatriumlaurethsulfosuccinat, Dinatriumlaurylsulfosuccinat und Dinatriumundecylenamido MEA-Sulfosuccinat

sowie

Schwefelsäureester, wie

1. Alkylethersulfat, beispielsweise Natrium-, Ammonium-, Magnesium-, MIPA-, TIPA-Laurethsulfat, Natriummyrethsulfat und Natrium C₁₂₋₁₃-Parethsulfat,
2. Alkylsulfate, beispielsweise Natrium-, Ammonium- und TEA- Laurylsulfat.

B. Kationische Tenside

Gegebenenfalls vorteilhaft zu verwendende kationische Tenside sind

1. Alkylamine,
2. Alkylimidazole,
3. Ethoxylierte Amine und
4. Quaternäre Tenside,
5. Esterquats.

Quaternäre Tenside enthalten mindestens ein N-Atom, das mit 4 Alkyl- oder Arylgruppen kovalent verbunden ist. Dies führt, unabhängig vom pH Wert, zu einer positiven Ladung. Vorteilhaft sind, Alkylbetain, Alkylamidopropylbetain und Alkyl-amidopropylhydroxysulfain. Die erfindungsgemäß verwendeten kationischen Tenside können ferner bevorzugt gewählt werden aus der Gruppe der quaternären Ammoniumverbindungen, insbesondere Benzyltrialkylammoniumchloride oder -bromide, wie beispielsweise Benzyltrimethylammoniumchlorid, ferner Alkyltrialkylammoniumsalze, beispielsweise Cetyltrimethylammoniumchlorid oder -bromid, Alkyldimethylhydroxyethylammoniumchloride oder -bromide, Dialkyldimethylammoniumchloride oder -bromide, Alkylamidethyltrimethylammoniumethersulfate, Alkylpyridiniumsalze, beispielsweise Lauryl- oder Cetylpyrimidiniumchlorid, Imidazolinderivate und Verbindungen mit kationischem Charakter wie Aminoxyde, beispielsweise Alkyldimethylaminoxyde oder Alkylaminoethyltrimethylammoniumoxyde. Vorteilhaft sind insbesondere Cetyltrimethylammoniumsalze zu verwenden.

C. Amphotere Tenside

Vorteilhaft zu verwendende amphotere Tenside sind

1. Acyl-/dialkylethylendiarnin, beispielsweise Natriumacylamphosacetat, Dinatriumacylamphodipropionat, Dinatriumalkylamphodiacetat, Natriumacylamphohydroxypropylsulfonat, Dinatriumacylamphodiaceat und Natriumacylamphopropionat,
2. N-Alkylaminosäuren, beispielsweise Aminopropylalkylglutamid, Alkylaminopropionsäure, Natriumalkyliminodipropionat und Lauroamphocarboxyglycinat.

D. Nicht-ionische Tenside

Vorteilhaft zu verwendende nicht-ionische Tenside sind

DE 199 62 369 A 1

1. Alkohole,
2. Alkanolamide, wie Cocamide MEA/DEA/MIPA,
3. Aminoxyde, wie Cocoamidopropylaminoxid,
4. Ester, die durch Veresterung von Carbonsäuren mit Ethylenoxid, Glycerin, Sorbitan oder anderen Alkoholen entstehen,
5. Ether, beispielsweise ethoxylierte/propoxylierte Alkohole, ethoxylierte/propoxylierte Ester, ethoxylierte/propoxylierte Glycerinester, ethoxylierte/propoxylierte Cholesterine, ethoxylierte/propoxylierte Triglyceridester, ethoxyliertes propoxyliertes Lanolin, ethoxylierte/propoxylierte Polysiloxane, propoxylierte POE-Ether und Alkylpolyglycoside wie Laurylglycosid, Decylglycosid und Cocoglycosid.
6. Sacrosester, -lther
7. Polyglycerinester, Diglycerinester, Monoglycerinester
8. Methylglucosester, Ester von Hydroxysäuren

Die nachfolgenden Beispiele sollen die vorliegende Erfindung verdeutlichen. Mengenangaben, Prozentangaben oder Teile beziehen sich, soweit nicht anders angegeben, auf das Gewicht, insbesondere auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen oder der jeweiligen Mischung.

Beispiel 1

O/W Crème

| | Gew.-% | |
|--|-----------|----|
| Glycerylstearat | 5,00 | |
| Cetylalkohol | 5,00 | |
| Isopropylpalmitat | 7,00 | 25 |
| Cyclomethicon | 5,00 | |
| Ascorbinsäure | 0,30 | |
| Camellia sinensis (Grünteextrakt) | 0,30 | |
| NaOH 45%ig | 1,00 | |
| Butylenglycol | 3,00 | 30 |
| Na ₂ H ₂ EDTA | 0,20 | |
| Ethanol | 2,00 | |
| Farbstoffe, Parfum, Konservierungsmittel | q.s. | |
| Wasser | ad 100,00 | 35 |

Die Bestandteile der Ölphase werden miteinander vereinigt, worauf das Gemisch homogenisiert, dann bei 60–70°C mit der ebenfalls vereinigten Wasserphase verrührt und homogenisiert wird. Hernach wird auf Raumtemperatur abgekühlt.

Beispiel 2

O/W Lotion

| | Gew.-% | |
|--|-----------|----|
| Stearoth-20 | 3,00 | |
| Cetylalkohol | 3,00 | |
| Cyclomethicon | 6,00 | |
| Carbomer | 0,60 | |
| Na ₂ H ₂ EDTA | 0,20 | 50 |
| Butylenglycol | 3,00 | |
| NaOH 45%ig | 0,40 | |
| Ascorbinsäure | 0,50 | |
| Camellia sinensis (Grünteextrakt) | 0,10 | |
| Ethanol | 1,00 | 55 |
| Farbstoffe, Parfum, Konservierungsmittel | q.s. | |
| Wasser | ad 100,00 | |

Beispiel 3

W/O Crème

| | Gew.-% | |
|-------------------------------------|--------|----|
| Polyglyceryl-2-dipolyhydroxystearat | 5,00 | 65 |
| Caprylic/Capric Triglyceride | 15,00 | |
| Butylenglycol | 3,00 | |

| | Gew.-% |
|---|-----------|
| $\text{Na}_2\text{H}_2\text{EDTA}$ | 0,20 |
| MgSO_4 | 0,70 |
| NaOH 45%ig | 0,32 |
| 5 Ascorbinsäure | 1,00 |
| <i>Camellia sinensis</i> (Grünteeextrakt) | 0,20 |
| Ethanol | 1,00 |
| Farbstoffe, Parfum, Konservierungsmittel | q.s. |
| Wasser | ad 100,00 |

10

Beispiel 4

O/W-Gel

| | Gew.-% |
|---|-----------|
| Xanthangummi | 2,00 |
| Butylenglycol | 3,00 |
| $\text{Na}_2\text{H}_2\text{EDTA}$ | 0,20 |
| NaOH 45%ig | 0,32 |
| 20 Ascorbinsäure | 1,00 |
| <i>Camellia sinensis</i> (Grünteeextrakt) | 0,50 |
| Ethanol | 1,00 |
| Farbstoffe, Parfum, Konservierungsmittel | q.s. |
| Wasser | ad 100,00 |

25

Beispiel 5

O/W-Haarkur

| | Gew.-% |
|--|-----------|
| Bis-Diglycorylpolyacetyladiipat-2 | 3,00 |
| Bhenylalkohol | 4,00 |
| Butylenglycol | 3,00 |
| 35 Cetrimoniumchlorid | 5,00 |
| Chlronensäure | 0,50 |
| $\text{Na}_2\text{H}_2\text{EDTA}$ | 0,20 |
| NaOH 45%ig | 0,16 |
| Ascorbinsäure | 0,50 |
| 40 <i>Camellia sinensis</i> (Grünteeextrakt) | 0,10 |
| Farbstoffe, Parfum, Konservierungsmittel | q.s. |
| Wasser | ad 100,00 |

45

Patentansprüche

1. Wirkstoffkombinationen aus
 - (a) Extrakten aus Blättern der Pflanzen der Ordnung Theales mit der Familie Theaceae, insbesondere der Spezies *Camellia spec.*, ganz besonders der Teesorten *Camellia sinensis*, *C. assamica*, *C. taliensis* bzw. *C. irrawadiensis* und Kreuzungen aus diesen mit beispielsweise *Camellia japonica* und/oder
 - (b) Catechinen und/oder
 - (c) Gallussäureestern von Catechinen und
 - (d) einer oder mehreren Ascorbylverbindungen, insbesondere einer oder mehreren wasserlöslichen Ascorbylverbindungen, insbesondere Ascorbinsäure.
2. Verwendung
 - (d) einer oder mehreren Ascorbylverbindungen, insbesondere einer oder mehreren wasserlöslichen Ascorbylverbindungen, insbesondere Ascorbinsäure,
 zur Stabilisierung bzw. Verbesserung der Lagerfähigkeit von
 - (a) Extrakten aus Blättern der Pflanzen der Ordnung Theales mit der Familie Theaceae, insbesondere der Spezies *Camellia spec.*, ganz besonders der Teesorten *Camellia sinensis*, *C. assamica*, *C. taliensis* bzw. *C. irrawadiensis* und Kreuzungen aus diesen mit beispielsweise *Camellia japonica* und/oder
 - (b) Catechinen und/oder
 - (c) Gallussäureestern von Catechinen.
3. Wirkstoffkombinationen nach Anspruch 1 oder Verwendung nach Anspruch 2, dadurch gekennzeichnet, daß das oder die Catechine gewählt wird oder werden aus der Gruppe (-)-Catechin, (+)-Catechin, (-)-Catechin Gallat, (-)-Gallocatechin Gallat, (+)-Epicatechin, (-)-Epicatechin, (-)-Epicatechin Gallat, (-)-Epigallocatechin, (-)-Epigallocatechin Gallat.
4. Wirkstoffkombinationen nach Anspruch 1 oder Verwendung nach Anspruch 2, dadurch gekennzeichnet, daß die

DE 199 62 369 A 1

Ascorbylverbindung gewählt wird aus der Gruppe Vitamin C und Derivaten wie z. B. Ascorbylpalmitat, Mg-Ascorbylphosphat, Ascorbylacetat.

5. Wirkstoffkombinationen nach Anspruch 1 oder Verwendung nach Anspruch 2 in kosmetischen oder dermatologischen Zubereitungen enthaltend pflanzliche Auszüge mit einem Gehalt an Catechinen, insbesondere solchen Zubereitungen, die Extrakte des grünen Tees enthalten.

6. Wirkstoffkombinationen nach Anspruch 1 oder Verwendung nach Anspruch 2 in kosmetischen oder dermatologischen Zubereitungen enthaltend 0,0001–20 Gew.-%, bevorzugt 0,001–10 Gew.-%, insbesondere bevorzugt 0,01–1 Gew.-% an Catechinen oder Gallussäureestern von Catechinen oder an wässrigen bzw. organischen Extrakten aus Pflanzen oder Pflanzenteilen, die einen Gehalt an Catechinen oder Gallussäureestern von Catechinen aufweisen, vorzugsweise Polyphenole bzw. Catechine aus der Gruppe (–)-Catechin, (+)-Catechin, (–)-Catechingallat, (–)-Gallocatechingallat, (+)-Epicatechin, (–)-Epicatechin, (–)-Epicatechin Gallat, (–)-Epigallocatechin, (–)-Epigallocatechingallat.

7. Wirkstoffkombinationen nach Anspruch 1 oder Verwendung nach Anspruch 2 in kosmetischen oder dermatologischen Zubereitungen enthaltend an einer oder mehreren Ascorbylverbindungen, insbesondere Ascorbinsäure, 0,001 Gew.-% bis 10 Gew.-%, bevorzugt zu 0,05 Gew.-% bis 5 Gew.-%, insbesondere bevorzugt zu 0,1–2,0 Gew.-%, an einer oder mehreren Ascorbylverbindungen, insbesondere Vitamin C und/oder Derivaten wie z. B. Ascorbylpalmitat, Mg-Ascorbylphosphat, Ascorbylacetat, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen.

- Leerseite -